

SERTRALINA

INFORMACIÓN GENERAL

La sertralina es un inhibidor selectivo de la recaptación de serotonina (ISRS). En las áreas del cerebro donde se encuentran las vías neuronales de la serotonina, ésta funciona para regular el estado de ánimo, el procesamiento de la memoria, el sueño y la cognición. Los ISRS tienen mecanismos de acción básicamente similares: ejercen su acción al bloquear la recaptación del neurotransmisor serotonina en el sistema nervioso central (SNC) para que no vuelva a ingresar a las células nerviosas (neuronas) después de que se descarga, lo que mejora los niveles de serotonina en el cerebro. Los neurotransmisores como la serotonina son mensajeros químicos producidos y liberados por las neuronas; transmiten impulsos nerviosos entre las células cerebrales. Los neurotransmisores facilitan la comunicación, o neurotransmisión, entre neuronas.

Durante la neurotransmisión, los neurotransmisores son liberados por una célula cerebral (neurona presináptica) a través de un espacio conocido como sinapsis y se unen a sitios conocidos como receptores en otra célula cerebral (neurona postsináptica). La señal química es atenuada por la neurona presináptica mediante un proceso conocido como recaptación, mediante el cual los neurotransmisores son recaptados nuevamente dentro de la célula, eliminando el exceso de neurotransmisores de la sinapsis. Por lo tanto, los medicamentos que inhiben la recaptación de neurotransmisores para que no regresen a las neuronas presinápticas pueden amplificar la neurotransmisión.

Se postula que la depresión y otros trastornos neuropsiquiátricos (p. ej., ansiedad) pueden ser causados por niveles bajos de los neurotransmisores serotonina, norepinefrina o dopamina en el cerebro. Estos neurotransmisores también se conocen como monoaminas porque comparten un grupo común (un grupo amina) en sus estructuras químicas. La teoría postula que la deficiencia de uno u otro de estos neurotransmisores monoaminas está implicada en la etiología de la depresión. Esta teoría (que la depresión se debe a una deficiencia de neurotransmisores monoaminas) se conoce como hipótesis de las monoaminas.

Sin embargo, la teoría es ineficaz para explicar la causa de la depresión porque los estudios no han logrado correlacionar consistentemente la depresión con la deficiencia de neurotransmisores. La causa de la depresión no es simplemente la deficiencia de neurotransmisores monoaminas, sino que puede encontrarse en otras áreas de la biología, como la genética.

La mayoría de los antidepresivos aumentan los niveles de uno o más neurotransmisores por sus variados mecanismos de acción. Algunos antidepresivos tienen una acción directa sobre los receptores del neurotransmisor. La acción de los antidepresivos sobre los neurotransmisores es casi inmediata, pero la respuesta clínica suele ser más gradual. Los pacientes pueden ver una mejoría clínica dentro de las primeras 2 semanas de tratamiento, con mejoras adicionales en sus síntomas en el transcurso de varias semanas. La inhibición de la recaptación de serotonina por la sertralina y otros ISRS, por ejemplo, aumenta los niveles de serotonina (inmediato) y, supuestamente, la neurotransmisión mejorada

estimula cambios (retardados) en el cerebro que ayudan a mejorar los síntomas de la depresión.

La Administración de Alimentos y Medicamentos de los Estados Unidos (FDA) ha aprobado la sertralina no sólo para la depresión sino también para el tratamiento del trastorno obsesivo-compulsivo (TOC), el trastorno de ansiedad social, el trastorno de pánico, el trastorno de estrés postraumático (TEPT) y el trastorno disfórico premenstrual (TDPM). El uso de un medicamento para sus indicaciones aprobadas por la FDA se denomina uso etiquetado. Sin embargo, en la práctica clínica, los médicos suelen recetar medicamentos para indicaciones no aprobadas (usos no aprobados) cuando los estudios clínicos publicados indican la eficacia y los estándares de la práctica médica respaldan la seguridad de esos tratamientos. Los usos no autorizados de la sertralina, por ejemplo, incluyen el tratamiento del trastorno de ansiedad generalizada, el manejo de la agresión en pacientes con lesión cerebral traumática, el abandono del hábito de fumar y el tratamiento de la depresión y otros trastornos neuropsiquiátricos en niños.

INFORMACIÓN DE DOSIFICACIÓN

Para la depresión y el TOC, la dosis inicial habitual de sertralina es de 50 mg una vez al día, que es mejor tomar por la mañana. Los pacientes de edad avanzada y las personas con enfermedades médicas pueden necesitar una dosis inicial más baja de 25 mg/día. La dosis se aumenta según sea necesario a intervalos semanales, hasta la dosis máxima recomendada de 200 mg/día.

Para el tratamiento del trastorno de ansiedad social, el trastorno de pánico y el trastorno de estrés postraumático, la dosis inicial recomendada es de 25 mg/día. La dosis se aumenta en 50 mg/día a intervalos semanales según sea necesario, hasta la dosis máxima recomendada de 200 mg/día. Para tratar los síntomas del síndrome disfórico premenstrual, la dosis inicial es de 50 mg/día durante todo el ciclo menstrual o solo la fase lútea del ciclo. Si la dosis inicial fue inadecuada, la dosis se aumenta en el siguiente ciclo. La dosis máxima recomendada para mujeres que toman sertralina diariamente durante el ciclo menstrual es de 150 g/día, o 100 mg/día si la dosis se realiza durante la fase lútea del ciclo.

La sertralina ha sido aprobada para el tratamiento del TOC en niños de 6 años en adelante. Para niños de 6 a 12 años, la dosis inicial recomendada es de 25 mg una vez al día; es de 50 mg/día para adolescentes de 13 a 17 años. La dosis se aumenta gradualmente según sea necesario a intervalos semanales, hasta la dosis máxima recomendada de 200 mg/día. También se debe considerar el peso del niño al determinar la dosis.

EFFECTOS SECUNDARIOS COMUNES

Los efectos secundarios más comunes de la sertralina son trastornos gastrointestinales, que incluyen náuseas, vómitos, indigestión, diarrea y pérdida de apetito. Nerviosismo, inquietud, dolores de cabeza, fatiga y dificultad para dormir son otros efectos secundarios comúnmente reportados. La somnolencia no es un efecto secundario infrecuente en algunos pacientes. Los niños que toman sertralina pueden presentar agitación, nerviosismo y, con poca frecuencia, comportamiento agresivo.

El insomnio se puede mitigar tomando la dosis de sertralina temprano en la mañana. Tomar sertralina con alimentos puede aliviar los efectos secundarios gastrointestinales.

REACCIONES ADVERSAS Y PRECAUCIONES

Los pacientes no deben suspender la sertralina sin consultar primero a su médico. Se debe suspender gradualmente disminuyendo la dosis. Dejar de tomar el medicamento

abruptamente, especialmente después de tomarlo regularmente durante períodos prolongados, puede desencadenar síntomas de interrupción (abstinencia), que incluyen dolores de cabeza, náuseas, vómitos, diarrea, insomnio, temblores, hormigueo en manos y/o piernas (parestesia) y posiblemente otras molestias desagradables. síntomas.

Aunque la función sexual puede verse afectada por la depresión, la sertralina a veces también puede causar disfunción sexual. Los efectos secundarios sexuales informados con la sertralina incluyen disminución de la libido, alteraciones de la eyaculación, disfunción eréctil y dificultad para alcanzar el orgasmo. Los pacientes no deberían avergonzarse de discutir esto con su médico, quien puede agregar un medicamento complementario para mitigar el problema o cambiar a otro antidepresivo que tenga menos probabilidades de tener estos efectos secundarios.

Algunos de los efectos secundarios de nerviosismo, nerviosismo e insomnio inducidos por los ISRS están relacionados con su activación del SNC. Algunos ISRS son más activadores que otros; La fluoxetina (Prozac) y la paroxetina (Paxil) se consideran agentes más potentes. En pacientes con antecedentes de manía, los ISRS pueden desencadenar un episodio maníaco y los pacientes deben ser conscientes de esta posible reacción adversa a su antidepresivo.

Se debe advertir a los pacientes sobre una reacción conocida como síndrome serotoninérgico cuando toman sertralina, que es un medicamento serotoninérgico. Los medicamentos serotoninérgicos aumentan la serotonina en el SNC. Si es excesivo, sobreviene el síndrome serotoninérgico. El síndrome serotoninérgico es una situación potencialmente mortal que requiere el cese inmediato de los medicamentos causantes y atención médica. Los síntomas típicos incluyen letargo, confusión, inquietud, enrojecimiento, sudoración profusa, temblores y espasmos y espasmos musculares incontrolables. Si no se trata, el síndrome serotoninérgico puede progresar a temperatura y presión arterial elevadas, tensión muscular excesiva, degradación muscular (rabdomiólisis), insuficiencia renal, coma y muerte. Se han informado casos de síndrome serotoninérgico con sertralina, pero generalmente estos casos implicaron tomar dos o más medicamentos que aumentaron la serotonina.

En raras ocasiones, la sertralina y otros ISRS se asocian con una afección conocida como síndrome de secreción inadecuada de hormona antidiurética (SIADH). La hormona antidiurética (ADH) es una hormona producida por el hipotálamo en el cerebro y transportada y almacenada en la glándula pituitaria, específicamente en la porción posterior de la glándula pituitaria. Con un cambio en el volumen sanguíneo (p. ej., deshidratación), la ADH se libera desde la glándula pituitaria posterior al torrente sanguíneo y se transporta a los riñones, donde ejerce su acción. Una de las funciones principales de la ADH es regular la reabsorción y retención de agua por los riñones. Por su acción hormonal, los riñones retienen y conservan el agua del cuerpo reabsorbiéndola en el torrente sanguíneo, lo que resulta en una menor producción de orina. El hipotálamo, a su vez, detecta el aumento del volumen de sangre debido a la cantidad de agua reabsorbida y, por tanto, disminuye la secreción de ADH. Este circuito de retroalimentación entre el hipotálamo y los riñones es el mecanismo homeostático (de equilibrio) para regular el volumen sanguíneo.

Medicamentos como la sertralina pueden inducir una liberación excesiva de ADH y, por tanto, un efecto secundario inadecuado del tratamiento. El exceso de ADH conduce a una reabsorción y retención excesiva de agua por parte de los riñones, lo que resulta en un mayor volumen de sangre (hipervolemia). Esto puede provocar una disminución por dilución de la concentración de sodio en sangre (hiponatremia). Dependiendo del grado de hiponatremia, el SIADH puede provocar un conjunto de síntomas (es decir, síndrome). Con hiponatremia leve, el paciente puede experimentar pérdida de apetito, dolor de cabeza, náuseas, vómitos,

debilidad muscular, fatiga y espasmos o calambres. Con hiponatremia grave, los síntomas incluyen irritabilidad, inquietud, confusión, convulsiones, pérdida del conocimiento o coma y muerte si no se trata. El diagnóstico de SIADH inducido por fármacos se puede realizar comprobando el nivel de sodio en plasma y la concentración en orina. Cuando se interrumpe la medicación causante, estos niveles vuelven a la normalidad.

Con la terapia antidepresiva, pueden existir riesgos de pensamientos y comportamientos suicidas en niños y adolescentes con trastornos depresivos y otros trastornos neuropsiquiátricos. El riesgo de los antidepresivos está relacionado con la edad, se asocia con pacientes menores de 24 años y es mayor durante el inicio del tratamiento. La FDA aconseja a los médicos que tengan precaución al tratar a pacientes pediátricos y agregó una advertencia sobre el riesgo de suicidio en las etiquetas de todos los antidepresivos.

RIESGO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA

La sertralina atraviesa la placenta desde la circulación materna. Sin embargo, según los datos disponibles, ni la sertralina ni su metabolito parecen aumentar el riesgo de teratogenicidad (malformaciones congénitas) en embarazos humanos. Este hallazgo está respaldado por estudios de reproducción en animales, que no revelaron evidencia de teratogenicidad.

Los bebés expuestos a la sertralina, así como a otros antidepresivos ISRS, al final del tercer trimestre del embarazo pueden desarrollar complicaciones después del nacimiento, como dificultad respiratoria, cianosis (tono de piel azulado por falta de oxígeno), irritabilidad, temblores, llanto constante y dificultad para alimentarse, y otros síntomas. Estos síntomas pueden ser causados por la toxicidad del antidepresivo o la manifestación de síntomas de interrupción después de la exposición materna en el útero. El uso de sertralina durante el embarazo puede estar justificado si suspender el antidepresivo plantea un mayor riesgo conocido para la madre que el riesgo potencial para el feto. Algunas mujeres pueden experimentar una recaída de la depresión si suspenden el antidepresivo, y la recaída puede representar un mayor riesgo para el bebé. Se debe advertir a las mujeres en edad fértil sobre los posibles riesgos para el feto si quedan embarazadas mientras toman este medicamento.

Las madres lactantes no deben tomar sertralina porque pasa a la leche materna y puede ser ingerida por el bebé. Si suspender el medicamento no es una alternativa, no se debe iniciar o interrumpir la lactancia.

POSIBLES INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

Los pacientes que toman warfarina (Coumadin) y anticoagulantes pueden estar predispuestos al riesgo de hemorragia con la adición de sertralina, que puede aumentar la actividad anticoagulante o la warfarina. La cimetidina (Tagamet) inhibe la degradación (metabolismo) de la sertralina y puede aumentar significativamente los niveles sanguíneos de sertralina, lo que puede contribuir a los efectos secundarios.

La sertralina puede inhibir el metabolismo de algunos medicamentos, aumentando así los niveles sanguíneos del fármaco afectado y el riesgo de reacciones adversas. Las interacciones farmacológicas importantes se producen con los antidepresivos tricíclicos (p. ej., amitriptilina) y ciertos medicamentos antiarrítmicos (p. ej., propafenona, flecainida), que pueden volverse tóxicos rápidamente cuando los niveles sanguíneos de estos medicamentos se elevan significativamente.

Los antidepresivos conocidos como inhibidores de la monoaminoxidasa (IMAO, por ejemplo, fenelzina, selegilina, isocarboxazida, tranilcipromina) y el antibiótico linezolid (Zyvox) están contraindicados con la sertralina porque, cuando se combinan, sus acciones serotoninérgicas aumentan en gran medida el riesgo de síndrome serotoninérgico. Se debe

permitir un período de lavado de 14 días cuando se suspende un IMAO antes de comenzar con sertralina y de manera similar cuando se suspende sertralina antes de introducir un IMAO. Además, otros fármacos que aumentan los niveles de serotonina en el SNC tienen un efecto aditivo con la acción serotoninérgica de la sertralina y pueden aumentar el riesgo de síndrome serotoninérgico. Los fármacos serotoninérgicos, por ejemplo, incluyen triptanes para la migraña (p. ej., sumatriptán), tramadol, antidepresivos serotoninérgicos (p. ej., ISRS, antidepresivos tricíclicos) y la hierba de San Juan.

Los pacientes deben evitar o minimizar el consumo de alcohol (un depresor) porque su uso excesivo frustrará los objetivos de la terapia.

SOBREDOSIS

Al igual que otros ISRS, la sertralina es más segura en caso de sobredosis que los antidepresivos tricíclicos anteriores y algunos de los antidepresivos más nuevos. No hay informes de muerte después de una sobredosis de sertralina sola. Se han informado muertes cuando se ingirió sertralina con depresores del SNC.

Cualquier sospecha de sobredosis debe tratarse como una emergencia. La persona debe ser llevada al departamento de emergencias para observación y tratamiento. También se debe llevar consigo el frasco de medicamento recetado (y cualquier otro medicamento que se sospeche que causa una sobredosis) porque la información en la etiqueta de la receta puede ser útil para que el médico tratante determine la cantidad de píldoras ingeridas.

También se puede contactar a la Asociación Estadounidense de Centros de Control de Envenenamientos (www.aapcc.org) a través de su línea de ayuda 1-800-222-1222, y pueden proporcionar la ubicación del centro de intoxicaciones local.

RESUMEN DEL TRATAMIENTO

El riesgo de suicidio es inherente a la depresión y puede persistir hasta que el individuo responda al tratamiento. Después de iniciar o cambiar la terapia antidepresiva, se debe observar de cerca a la persona, especialmente a un niño o adolescente, para detectar signos de empeoramiento de la depresión, y la familia o el cuidador deben comunicar cualquier inquietud al médico.

- **Advertencia:** Informe siempre a su médico o a un miembro de su familia si tiene pensamientos suicidas. Notifique a su médico cada vez que sus síntomas depresivos empeoren o cuando se sienta incapaz de controlar sus impulsos o pensamientos suicidas.
- No suspenda la sertralina sin consultar a su médico. La sertralina debe suspenderse gradualmente disminuyendo gradualmente la dosis. Detener el medicamento abruptamente puede desencadenar síntomas de abstinencia.
- Si la sertralina afecta su sueño, tómela por la mañana.
- Si olvida una dosis, tómela lo antes posible. Si está cerca de la siguiente dosis programada, omita la dosis olvidada y continúe con su horario de dosificación habitual. No tome una dosis doble.
- La sertralina se puede tomar con o sin alimentos.
- Evite el alcohol mientras toma sertralina porque el alcohol puede aumentar los efectos secundarios del SNC.
- Tenga en cuenta que es posible que los beneficios de la sertralina no se noten de inmediato. Pueden pasar semanas antes de que se logren completamente los beneficios de la sertralina.

- Guarde el medicamento en su envase resistente a la luz, etiquetado originalmente, lejos del calor y la humedad. El calor y la humedad pueden precipitar la degradación de su medicamento y éste puede perder sus efectos terapéuticos.
- Mantenga sus medicamentos fuera del alcance de los niños.

Si tiene alguna pregunta sobre su medicación, consulte a su médico.

Tomado de: Chew, H. R., Hales, R. E y Yudofsky S. C. (2017). *What your patients need to know about psychiatric medications*. EE. UU.: American Psychiatric Association Publishing.